

(12) 按照专利合作条约所公布的国际申请

(19) 世界知识产权组织
国际局



(43) 国际公布日:

2005年8月11日(11.08.2005)

PCT

(10) 国际公布号:

WO 2005/073209 A1

(51) 国际分类⁷: C07D 305/14

(21) 国际申请号: PCT/CN2005/000068

(22) 国际申请日: 2005年1月17日(17.01.2005)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:
200410021751.8 2004年1月16日(16.01.2004) CN

(71) 申请人(对除美国以外的所有指定国): 桂林晖昂生化
药业有限责任公司(GUILIN HUIANG
BIOCHEMISTRY PHARMACEUTICAL CO., LTD)
[CN/CN]; 中国广西桂林市高新区毅丰南路8号,
Guangxi 541004 (CN).

(72) 发明人:及

(75) 发明人/申请人(仅对美国): 唐丁宁(TANG, Dingning)
[CN/CN]; 李健(LI, Jian) [CN/CN]; 中国广西桂林市
高新区毅丰南路8号, Guangxi 541004 (CN).

(74) 代理人: 中国专利代理(香港)有限公司(CHINA
PATENT AGENT (H.K.) LTD.); 中国香港湾仔港湾
道23号鹰君中心22字楼, Hong Kong (CN).

(81) 指定国(除另有指明, 要求每一种可提供的国家保护):
AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW,
BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM,
DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR,
HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC,
LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN,
MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL,
PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SY, TJ,
TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU,
ZA, ZM, ZW

(84) 指定国(除另有指明, 要求每一种可提供的地区保护):
ARIPO(BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD,
SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), 欧亚专利(AM, AZ, BY,
KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), 欧洲专利(AT, BE, BG,
CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU,
IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK,
TR), OAPI(BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ,
GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG)

本国际公布:

— 包括国际检索报告。

所引用双字母代码和其它缩写符号, 请参考刊登在每期
PCT公报期刊起始的“代码及缩写符号简要说明”。

(54) Title: METHOD FOR THE PREPARATION OF SYNTHESIZED TAXANOIDS

(54) 发明名称: 合成紫杉烷类物质的制备方法

(57) Abstract: This invention relates to the preparation process of synthesized taxanoids, including protection the 7-OH with rare earth elements compounds. In this process, the reactions are simple, and the binding is firm and reliable. And in the subsequent process, no acrylated 7-OH product will be produced, at the same time, it become readily controllable for the hydrolysis of 2'- ester group of the acrylated product. In the preparation process of synthesized taxanoids of the present invention, THF is used as medium for the acrylation reaction, and can not only achieve the same effect as that of pyridine, but also avoid the unpleasant odour, thus solve the problem of extremely high requirements for the field of production. The method of the present invention can be used not only for the preparation of semi-synthesized taxanes starting from natural taxanoids, but also for preparation of the total-synthesized taxanes.

(57) 摘要

本发明涉及合成紫杉烷的制备工艺, 它利用稀土元素化合物对 7-OH 进行保护, 反应简单, 结合牢固可靠, 在其后的过程中既不产生 7-位酰化物, 也使得酰化后的产物在 2'-酯基的水解变得容易控制。在合成紫杉烷的制备工艺中, 本发明使用四氢呋喃作酰化反应的介质, 不但能取得吡啶同样的效果, 而且还避免了臭味, 解决了对生产现场要求极高的难题。本发明既可用于以天然紫杉烷类物质为原料的半合成紫杉烷的制备, 也可用于全合成紫杉烷的制备。